

03613T-BDE.

B5-D21-E17.

AVON, 29-06-70.

US-050944. T03.

Avon Products Inc.

\*DT-2131630-N.

E16-gahi.

A61k-07/00 (05-01-72)...

REMOVING KERATINOUS SUBSTANCES - WITH AQ.  
SOLN. CONTG DITHIOBUTANEDIOL AND GUANIDINE  
CPDS.,

B10-A17, B10-E3.

2 16

EXAMPLE

A depilatory composn. contains (in wt.%): DTT 1.0, guanidine hydrochloride 9.55, carboxymethylcellulose 5.0, wetting agent 0.012, the balance being water. The pH is adjusted to 11 with 1N NaOH.

NEW

Composn. for removing keratinous substances, esp. hair, corns, etc., from human or animal body consists of an aqs. soln. contng. at least 0.25 wt.% of dithiobutanediol (pref. dithioerythritol (DTE) and/or dithiothreitol (DTT) and 0.01-40 wt.% (pref. 0.1-16%) of a water-sol. guanidine cpd. (pref. guanidine hydrochloride), and the pH is at least 9.

DETAILS

The amt. of DTE or DTT may be 0.25-10 wt.% or more, but from the point of view of economy 1-2 wt.% is preferred.

ADVANTAGE

Rapid action without skin irritation; no smell.

03613T

51

Int. Cl.:

A 61 k, 7/0

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

DEUTSCHES PATENTAMT



52

Deutsche Kl.: 30 h, 13/01

10

11

21

22

43

# Offenlegungsschrift 2131 630

Aktenzeichen: P 21 31 630.3

Anmeldetag: 25. Juni 1971

Offenlegungstag: 5. Januar 1972

Ausstellungspriorität: —

30

Unionspriorität

32

Datum: 29. Juni 1970

33

Land: V. St. v. Amerika

31

Aktenzeichen: 50944

54

Bezeichnung: Mittel zur Entfernung von Hornsubstanzen, insbesondere Haaren

61

Zusatz zu: —

62

Ausscheidung aus: —

71

Anmelder: Avon Products, Inc., New York, N. Y. (V. St. A.)

Vertreter gem. § 16 PatG: Kohler, R., Dipl.-Phys.; Schwindling, H., Dipl.-Phys.;  
Späth, S., Dipl.-Ing.; Patentanwälte, 7000 Stuttgart

72

Als Erfinder benannt: Gadzala, Antoni Edward, Suffern, N. Y.;  
Highley, Derck Rowland, Upper Saddle River, N. Y. (V. St. A.)

ORIGINAL INSPECTED

12.71 109 882/1866

7/90

DI 2131 630

2131630

Anmelderin:  
Avon Products, Inc.  
30 Rockefeller Plaza  
New York, N.Y., V.St.A.

Stuttgart, den 23. Juni 1971  
P 2353 S/kg

Mittel zur Entfernung von Hornsubstanzen,  
insbesondere Haaren

Gegenwärtig werden zahlreiche Verfahren zur Entfernung von Hornsubstanzen, wie beispielsweise Haaren, Häutchen und Hornhaut, von tierischen Körpern verwendet. Diese Verfahren umfassen Rasieren, Schaben, Auszupfen und die Anwendung von Elektrolyse sowie chemischer Präparate, insbesondere von Alkalimetall- und Erdalkalimetallverbindungen, Thioglycollaten sowie gewissen Hydrogensulfidsalzen und deren Derivate. Die genannten mechanischen Mittel sind unbefriedigend, weil sie entweder zu zeitraubend sind, wie beispielsweise das Auszupfen von Haaren.

./.

109882/1866

BAD ORIGINAL

oder die Gefahr einer Verletzung durch Schneiden mit dem verwendeten Werkzeug in sich bergen, wie beispielsweise bei der Verwendung von Rasiermessern und -apparaten beim Rasieren der Haut zur Entfernung von Haar oder bei der Entfernung von Häutchen mit Hilfe von Scheren.

Bei der Anwendung chemischer Präparate besteht das Problem einer Reizung der Haut und es haben außerdem manche Präparate, wie beispielsweise die Sulfide, einen unangenehmen Geruch, der diese Präparate für den Handel ungeeignet macht. Weiterhin ist von großer Bedeutung, daß es bisher nicht möglich war, ein chemisches Präparat zur Entfernung aller Hornsubstanzen zu verwenden. So sind beispielsweise für eine Enthaarung geeignete Präparate nicht zur Entfernung von Häutchen geeignet.

Demgemäß liegt der Erfindung die Aufgabe zugrunde, ein Mittel zur Entfernung von Hornsubstanzen vom tierischen Körper, einschließlich dem menschlichen Körper, zu schaffen, das nur einen geringen oder überhaupt keinen Geruch aufweist, schnell wirkt und die Haut nicht reizt.

Diese Aufgabe wird nach der Erfindung dadurch gelöst, daß das Mittel, bezogen auf das Gesamtgewicht, im wesentlichen aus mindestens etwa 0,25 Gew.% Dithiobutandiol und etwa 0,01 bis 40 Gew.% einer wasserlöslichen Guanidinverbindung besteht und einen pH-Wert von mindestens 9 aufweist.

Das erfindungsgemäße Mittel enthält also als Hauptkomponenten eine Kombination von 2,3-Dihydroxy-1,4-dithiobutan und eine wasserlösliche Guanidinverbindung. Die verwendeten

./.

109882/1866

BAD ORIGINAL

2,3-Dihydroxy-1,4-dithiobutanverbindungen sind Dithiothreitol (DTT) und Dithioerythritol (DTE), also beide Isomeren des Dithiobutandiols. Bei der verwendeten Guanidinverbindung kann es sich um Guanidin oder eines seiner wasserlöslichen, sauren Salze handeln. Von den Salzen wird Guanidinhydrochlorid bevorzugt.

Diese wesentlichen Komponenten können in einer wässrigen Lösung verwendet werden, jedoch können zu dem Mittel andere Stoffe hinzugefügt werden, um das Mittel für den Handel geeigneter zu machen. So kann beispielsweise jede pharmakologisch geeignete Salbengrundlage verwendet werden. Beispiele hierfür sind in den folgenden, speziellen Beispielen angegeben, jedoch versteht es sich, daß jede der üblichen Salbengrundlagen und jedes Verdickungsmittel benutzt werden kann, wie beispielsweise pflanzliche und synthetische Gummi, Carboxymethylcellulose und dergleichen. Diese Stoffe sind selbstverständlich nicht toxisch und dienen dazu, die aktiven Komponenten mit den Hornsubstanzen in Berührung zu halten. Während beispielsweise wässrige Lösungen für die Entfernung von Häutchen, insbesondere der Nagelhaut, besonders geeignet sind, sind solche Lösungen nicht als kommerzielle Depilationsmittel geeignet, weil sie nicht an der Stelle bleiben, wo sie auf den Körper aufgetragen worden sind.

Es werden etwa 0,25 Gew.% an DTT oder DTE, bezogen auf das Gesamtgewicht des Mittels, benötigt. Es können Mengen über 10 Gew.% verwendet werden, jedoch sind solche

./.

109882/1866

109882/1866

Mengen im Hinblick auf die Kosten wirtschaftlich unbefriedigend. Vorzugsweise werden etwa 1 bis 2 Gew.% verwendet. Von der Guanidinverbindung wird vorzugsweise eine Menge zwischen 0,01 und 16 Gew.% verwendet, jedoch ist auch ein Anteil zwischen 0,01 und etwa 40 Gew.% möglich.

Der pH-Wert des Mittels kann mit Hilfe jedes üblichen alkalischen Stoffes eingestellt werden, beispielsweise mit NaOH oder einem Puffer. Obwohl ein pH-Wert von 12 und mehr benutzt werden kann, ist allgemein anzustreben, den pH-Wert unter 12 zu halten, um die Möglichkeit einer Hautreizung gering zu halten. Überraschend hat sich herausgestellt, daß eine Depilation, die Entfernung von Häutchen und dergleichen Hornsubstanzen noch stattfinden kann, wenn die verwendeten Mittel einen so geringen pH-Wert wie etwa 9 haben. In solchen Fällen kann es erforderlich sein, das Mittel eine längere Zeitspanne einwirken zu lassen oder mit einer höheren Konzentration von DTT oder DTE zu versehen, als wenn es mit einem höheren pH-Wert verwendet würde.

Bei der Entfernung von Hornsubstanzen, wie beispielsweise menschlichem Haar, wird das erfindungsgemäße Mittel auf die Fläche aufgebracht, von der das Haar zu entfernen ist, und für eine ausreichende Zeit auf dieser Stelle belassen, um im wesentlichen eine Auflösung des Haares, also eine Zerstörung der Disulfidbindungen, an der Stelle zu bewirken, an der das Haar die Haut berührt. Bei einem Gehalt von DTT oder DTE zwischen etwa 1 und 2 Gew.% und

./.

einem pH-Wert von etwa 11 ist dieser Zustand gewöhnlich nach etwa 2 bis 15 Minuten erreicht. Bei einem höheren Gehalt von DTT oder DTE bei einem pH-Wert von 11 wird die Kontaktzeit vermindert. Bei einem pH-Wert von 9 wird ein Gehalt von etwa 5 Gew.% DTT oder DTE für eine Enthaarung in der gleichen Zeitspanne benötigt. Danach wird das Mittel von der Haut entfernt, wodurch gleichzeitig auch die Haare entfernt werden.

Es sei besonders darauf hingewiesen, daß das Mittel auf dem Körper nicht länger belassen zu werden braucht, als erforderlich ist, um das Haar, das Häutchen oder andere Hornsubstanzen an der Stelle zu lösen, an der es den Körper berührt. Wenn beispielsweise die Nagelhaut entfernt werden soll, wird durch das Aufbringen des Mittels derjenige Teil der Nagelhaut gelöst, der die Nagelhaut mit dem Nagel verbindet, bevor die ganze Nagelhaut selbst aufgelöst ist. Das Entfernen des Mittels zu diesem Zeitpunkt hat also auch eine Entfernung der abgelösten Nagelhaut zur Folge. Wie erwähnt, hängt der Zeitbedarf von dem pH-Wert und der Konzentration an DTT und/oder DTE ab, jedoch werden gewöhnlich für eine Behandlung der Hornsubstanzen nur etwa 2 bis 15 Minuten benötigt.

Die Erfindung wird im folgenden anhand einiger Beispiele erläutert.

#### Beispiel I

Es wurde ein Mittel durch Mischen der folgenden Substanzen hergestellt:

./.

	<u>Gew. %</u>
DTT	1,0
Guanidinhydrochlorid	9,55
Carboxymethylcellulose	5,0
Netzmittel	0,012
Wasser	q.s.

Die Mischung wurde mit 1 N-NaOH auf pH 11 eingestellt und dann auf eine Fläche auf dem Rücken von Meerschweinchen aufgebracht. Nach zwei Minuten wurde das Präparat abgewischt und die Fläche untersucht.

Die Wirksamkeit der Enthaarung wurde nach dem folgenden Ziffernsystem bewertet:

- 0 = sauber (vollständige Entfernung der Haare, keine Stoppeln)
- 1 = sehr fein verstreute Stoppeln auf der freiliegenden Fläche
- 2 = feine Stoppeln über der ganzen freiliegenden Fläche
- 3 = deutliche Stoppeln
- 4 = keine sichtbare Entfernung von Haaren

Die Mischung wurde mit 0,5 eingestuft und es wurde jeder unmittelbar nach dem Entfernen der Mischung noch 24 Stunden später ein Erythem der Haut beobachtet.

Die gleiche Mischung wurde in der beschriebenen Weise beim Meerschweinchen angewendet, jedoch auf der Haut vier Minuten lang belassen. Die Mischung wurde erneut mit 0,5 eingestuft und es wurde wieder sofort noch nach 24 Stunden ein Erythem beobachtet.

./.

109882/1866



### Beispiel II

Es wurde eine Reihe von Mischungen A bis H unter Verwendung des Rezeptes der Mischung nach Beispiel I hergestellt, jedoch wurde der pH-Wert mit NaOH auf 11,3 eingestellt und die Konzentration an DTT variiert. Die Mischungen wurden bei Meerschweinchen fünf Minuten lang angewendet und es wurde die Wirksamkeit der Enthaarung wie im Beispiel I angegeben bewertet. Es wurden folgende Resultate erzielt:

	Konz. DTT Gew.%	Enthaarungs- note	Hautreizung	
			sofort	nach 24 Stunden
A.	0,5 Gew.%	3,0	keine	keine
B.	1,0 Gew.%	1,0	"	"
C.	1,5 Gew.%	0,5	"	"
D.	2,0 Gew.%	0,5	"	"
E.	2,5 Gew.%	0,5	"	"
F.	3,0 Gew.%	0,5	"	"
G.	3,5 Gew.%	0,5	"	"
H.	4,0 Gew.%	0,5	"	"

### Beispiel III

Es wurde eine weitere Reihe von Mischungen A bis H nach dem Rezept des Beispiels I hergestellt, jedoch mit einem mit NaOH auf 11,3 eingestellten pH-Wert und verschiedenen Konzentrationen von Guanidin. Diese Mischungen wurden bei Meerschweinchen fünf Minuten lang angewendet und es wurde die Wirksamkeit der Enthaarung wie im Beispiel I angegeben bewertet. Es wurden folgende Resultate erzielt:

./.

	<u>Konz. von Guanidin- hydrochlorid</u>	<u>Enthaarungs- note</u>	<u>Hautreizung</u>	
			<u>sofort</u>	<u>nach 24 Std.</u>
A.	0,5 Gew.%	2,00	keine	keine
B.	1,0 "	1,00	"	"
C.	1,5 "	0,75	"	"
D.	2,0 "	0,75	"	"
E.	2,5 "	0,75	"	"
F.	3,0 "	0,75	"	"
G.	3,5 "	0,75	"	"
H.	4,0 "	0,75	"	"

Beispiel IV

Es wurde unter Verwendung des Rezeptes nach Beispiel I, jedoch mit einer gleichen Menge DTE anstatt von DTT, eine Reihe von Mischungen A bis E hergestellt. In dieser Reihe wurde der pH-Wert variiert und es wurden die Mittel bei Meerschweinchen fünf Minuten lang angewendet. Die Wirksamkeit wurde wie im Beispiel I bewertet. Es wurden die folgenden Resultate erzielt:

	<u>pH</u>	<u>Note</u>	<u>Hautreizung</u>	
			<u>sofort</u>	<u>nach 24 Std.</u>
A.	9,0	4,0	keine	keine
B.	11,0	0,5	"	"
C.	11,3	0,5	"	"
D.	11,5	1,0	"	"
E.	12,0	0,5	"	"

Beispiel V

Es wurde ein Mittel durch Mischen der folgenden Bestandteile hergestellt:

	<u>Gew.%</u>
DTT	5,0
nichtionisches Netzmittel	0,01
Carboxymethylcellulose	5,6
Guanidinhydrochlorid	9,55
Wasser	q.B.

109882/1866

./.

Die Mischung wurde in vier Teilmengen A bis D unterteilt. Die Teilmenge A wurde auf pH 9, die Teilmenge B auf pH 10, die Teilmenge C auf pH 11 und die Teilmenge D auf pH 12 mit 1N-NaOH eingestellt. Jede Teilmenge der Mischung wurde dann auf eine Fläche auf dem Rücken von drei Meerschweinchen aufgebracht und dort 64 Minuten belassen. Die Wirksamkeit der Enthaarung wurde in regelmäßigen Intervallen bewertet. In jedem Fall hatte eine vollständige Enthaarung nach etwa 15 Minuten stattgefunden.

#### Beispiel VI

Es wurde die Mischung nach Beispiel I auf die Nagelhaut eines menschlichen Fingernagels für eine Zeit von etwa 1 Minute aufgebracht. Danach wurde die Mischung entfernt, beispielsweise durch Waschen, und die Nagelhaut durch einfaches Trennen vom Fingernagel entfernt. Es wurden weder an den behandelten Nägeln noch der benachbarten Haut nachteilige Wirkungen beobachtet.

#### Beispiel VII

Die Mischung nach Beispiel I wurde auf eine Schwielle menschlicher Haut für etwa 2 Minuten aufgebracht und dann entfernt. Die Schwielle wurde weitgehend aufgelöst und konnte von der Haut durch leichtes Kratzen entfernt werden.

#### Beispiel VIII

Es wurde in der unten angegebenen Weise eine Reihe von Grundlagen hergestellt und es wurden zu jeder Grundlage 1 Gew.% DTT und 9,55 Gew.% Guanidinhydrochlorid hinzu-

./.

gegeben. In jedem Fall hatte das resultierende Mittel eine geeignete Wirkung auf Hornsubstanzen.

<u>A. Einfache Emulsionsgrundlage</u>		<u>Gew. %</u>
Glycerinmonostearat		8,0
Anionisches Netzmittel		0,25
Propylparaben		0,1
Methylparaben		0,15
Wasser		q.s.
<u>B. Cremegrundlage</u>		<u>Gew. %</u>
Carboxyvinylpolymer		0,9
Nichtionisches Netzmittel		2,0
Oberflächenaktives Multisterinextrakt		1,0
Wachsfreies Lanolin		1,0
Glycerin		10,0
Wasser		q.s.
<u>C. Lotiongrundlage</u>		<u>Gew. %</u>
Glycerinmonostearat		5,0
Cetylalkohol		1,0
Myristylmyristat		3,0
Oberflächenaktives Multisterinextrakt		2,0
Polyoxyäthylenäther höherer aliphatischer Alkohole		0,5
Sesamöl		5,0
Butylhydroxyanisol		0,02
Nichtionisches Netzmittel		1,5
Natriumsalz der Diäthylen- triaminpentaessigsäure		0,05
Formalin		0,1
Parfum		0,15
Wasser		q.s.

109882/1866

Es versteht sich, daß die Erfindung nicht auf die behandelten Beispiele beschränkt ist, die nur zur Erläuterung der Erfindung dienen, sondern Abweichungen davon möglich sind, ohne den Rahmen der Erfindung zu verlassen.

./.

Patentansprüche

1. Mittel zur Entfernung von Hornsubstanzen, insbesondere Haaren, von tierischen Körper, dadurch gekennzeichnet, daß es, bezogen auf das Gesamtgewicht, im wesentlichen aus mindestens etwa 0,25 Gew.% Dithiobutandiol und etwa 0,01 bis 40 Gew.% einer wasserlöslichen Guanidinverbindung besteht und einen pH-Wert von mindestens 9 aufweist.
2. Mittel nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das Dithiobutandiol Dithiothreitol und/oder Dithioerythritol ist.
3. Mittel nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Dithiothreitol etwa 1 bis 2 Gew.% beträgt.
4. Mittel nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Guanidinverbindung Guanidinhydrochlorid ist.
5. Mittel nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß es eine pharmakologisch geeignete Salbengrundlage enthält.
6. Mittel nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Dithiobutandiol etwa 0,25 bis 10 Gew.% und an der Guanidinverbindung etwa 0,1 bis 16 Gew.% beträgt.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☒ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**